

⑪ 日本国特許庁 (JP)

⑫ 特許出願公開

⑬ 公開特許公報 (A)

昭58—219107

⑭ Int. Cl.³
A 61 K 7/18

識別記号

庁内整理番号
6675—4C

⑮ 公開 昭和58年(1983)12月20日

発明の数 2
審査請求 未請求

(全 9 頁)

⑯ 口腔衛生用製品

⑰ 特 願 昭58—39979

⑱ 出 願 昭58(1983)3月10日

優先権主張 ⑲1982年3月10日⑳米国(US)

㉑356678

㉒1983年2月3日㉓米国(US)

㉔463378

㉕発 明 者 マイケル・ジョセフ・モブレー

アメリカ合衆国オハイオ州フェ
アフィールド・デルクレスト・
コート6182

㉖出 願 人 ザ・プロクター・エンド・ギヤ
ンブル・カンパニー

アメリカ合衆国オハイオ州シン
シナチ・イースト・シツクス
・ストリート301

㉗代 理 人 弁理士 猪股清 外3名

明 細 書

1. 発明の名称 口腔衛生用製品

2. 特許請求の範囲

1. (A) 以下の(B)項に定義される可溶性カルシウム
少なくとも約0.015%を使用時に与えること
ができるカルシウムイオン源、

(B) CaF_2 の沈殿速度を制御する際に有効な
カルシウム金属イオン封鎖剤またはカルシウム
金属イオン封鎖剤の混合物〔前記金属イオン封
鎖剤は総可溶性カルシウム(前記総可溶性カル
シウムはイオン性カルシウムおよび金属イオン
封鎖剤によつて錯化されたカルシウムの両方か
らなる)を0.015%以下に減少させないもので
あり、そして次式

$$K_m = \frac{[\text{CaA}]}{[\text{Ca}][\text{A}]}$$

(式中、 $[\text{Ca}]$ は非錯化カルシウムイオンの総
モル濃度であり、 $[\text{A}]$ は如何なる金属イオンに

よつても錯化されていない可溶性金属イオン封
鎖剤の総モル濃度であり、そして $[\text{CaA}]$ はカル
シウムによつて錯化された可溶性金属イオン封
鎖剤の総モル濃度である)

によつて定義される有効安定度定数(K_m)が約
 $10^{2.8}$ ~ 約 10^6 ^{ものである} ℓ /モルの範囲である)、およ
び

(C) 使用時にフルオリド約0.0015% ~ 約0.5
%を与えることができるフッ素イオン源
からなり、水溶液の場合または唾液で希釈した
場合に25℃ ~ 37℃において約4.5 ~ 約8.8の
pHを有することを特徴とする抗むし歯保護を
歯に与える口腔衛生用製品。

2. 前記製品が2つの組成物の形態であり、一方
の組成物がカルシウム金属イオン封鎖剤および
カルシウムイオン源を含有し、そして他方の組
成物がフッ素イオン源を含有し、両組成物が水
溶液の場合または唾液で希釈した場合に約4.5
~ 約8.8の pHを有する特許請求の範囲第1項
に記載の口腔衛生用製品。

3. カルシウム金属イオン封鎖剤またはカルシウム金属イオン封鎖剤の混合物が、約 $10^{3.3}$ ～約 $10^{5.3}$ g/モルの範囲の有効安定度定数 (K_m) を有する特許請求の範囲第2項に記載の口腔衛生用製品。
4. カルシウム金属イオン封鎖剤が、置換イミノジ酢酸、置換イミノトリ酢酸、クエン酸、これらの金属イオン封鎖剤のナトリウム塩、カリウム塩、およびカルシウム塩およびそれらの混合物からなる群から選択される特許請求の範囲第3項に記載の口腔衛生用製品。
5. カルシウム金属イオン封鎖剤が N-(2-ヒドロキシエチル)-イミノジ酢酸、ニトリロトリ酢酸、N-(2-カルボキシエチル)-イミノジ酢酸、DL-2-メチルニトリロトリ酢酸、N-(ホスホノメチル)-イミノジ酢酸、N-(2-スルホエチル)-イミノジ酢酸、DL-N-(2-ヒドロキシエチル)-2-メチルイミノジ酢酸、N-(2-メトキシエチル)-イミノジ酢酸、N-(2-オキソプロピル)-イ

ム塩、およびそれらの混合物からなる群から選択される特許請求の範囲第6項に記載の口腔衛生用製品。

8. 前記フッ素イオン源がフッ素イオン約0.02%～約0.10%を与えることができ、そしてフッ化ナトリウム、フッ化第一スズ、フッ化カリウム、フッ化亜鉛、フッ化ベタイン、フッ化第一スズアラニン、フルオロケイ酸ナトリウム、フッ化ヘキシルアミン、モノフルオロリン酸ナトリウム、およびそれらの混合物からなる群から選択される特許請求の範囲第7項に記載の口腔衛生用製品。
9. 前記フッ素イオン源がフッ化ナトリウムである特許請求の範囲第8項に記載の口腔衛生用製品。
10. 歯洗口料の形態である特許請求の範囲第2項に記載の口腔衛生用製品。
11. 単一の洗口料組成物の形態である特許請求の範囲第1項に記載の口腔衛生用製品。
12. (A) 以下の(B)項に定義される可溶性カルシウ

ミノジ酢酸、N-アセトアミドイミノジ酢酸、N-ヒドロキシエチルエチレンジアミントリ酢酸、2-アミノベンゾイック-N,N-ジ酢酸、N,N-ビス-(2-ヒドロキシエチル)-エチレンジニトリロ-N',N'-ジ酢酸、クエン酸、これらの金属イオン封鎖剤のナトリウム塩、カリウム塩およびカルシウム塩、およびそれらの混合物からなる群から選択される特許請求の範囲第4項に記載の口腔衛生用製品。

6. 前記カルシウムイオン源が水酸化カルシウム、塩化カルシウム、酢酸カルシウム、ギ酸カルシウム、乳酸カルシウム、硝酸カルシウム、グルコン酸カルシウム、グリセロリン酸カルシウム、安息香酸カルシウム、イソ酪酸カルシウム、プロピオン酸カルシウム、サリチル酸カルシウム、金属イオン封鎖剤のカルシウム塩、およびそれらの混合物からなる群から選択される特許請求の範囲第5項に記載の口腔衛生用製品。
7. 前記カルシウムイオン源が水酸化カルシウム、塩化カルシウム、金属イオン封鎖剤のカルシウ

ム少なくとも0.015%を使用時に与えることができるカルシウムイオン源、

(B) CaF_2 の沈殿速度を制御する際に有効であるカルシウム金属イオン封鎖剤またはカルシウム金属イオン封鎖剤の混合物(前記金属イオン封鎖剤は総可溶性カルシウム(前記総可溶性カルシウムはイオン性カルシウムおよび金属イオン封鎖剤によつて錯化されたカルシウムの両方からなる)を0.015%以下に減少させないものであり、そして次式

$$K_m = \frac{[\text{CaA}]}{[\text{Ca}][\text{A}]}$$

(式中、 $[\text{Ca}]$ は非錯化カルシウムイオンの総モル濃度であり、 $[\text{A}]$ は如何なる金属イオンによつても錯化されない可溶性金属イオン封鎖剤の総モル濃度であり、そして $[\text{CaA}]$ はカルシウムによつて錯化された可溶性金属イオン封鎖剤の総モル濃度である)

によつて定義される有効安定度定数 (K_m) が約 $10^{2.8}$ ～約 10^6 g/モルの範囲であるものである)

(C) フルオリド約0.0015%～約0.5%を与えることができるフッ素イオン源からなり、水溶液の場合または唾液で希釈した場合に25℃～37℃で約4.5～約8.8のpHを有する製品を適用することを特徴とする抗むし歯保護を歯に与える方法。

13. 製品が一方の組成物内に金属イオン封鎖剤およびカルシウムイオン源を有し、そして別の組成物内にフッ素イオン源を有し、そして両方の口腔組成物は水溶液の場合または唾液で希釈した場合に25℃～37℃において約6.5～約7.8のpHを有する特許請求の範囲第12項に記載の方法。

14. カルシウム金属イオン封鎖剤またはカルシウム金属イオン封鎖剤の組み合わせが約 $10^{3.3}$ ～約 $10^{5.3}$ g/モルの範囲の有効な安定度定数(Km)を有する特許請求の範囲第13項に記載の方法。

15. カルシウム金属イオン封鎖剤が置換イミノジ酢酸、置換イミノトリ酢酸、クエン酸、これら

化合物からなる群から選択される特許請求の範囲第15項に記載の方法。

17. カルシウム金属イオン封鎖剤がN-(2-ヒドロキシエチル)-イミノジ酢酸、N-ヒドロキシエチルエチレンジアミントリ酢酸、N-アセトアミドイミノジ酢酸、ニトリロトリ酢酸、これらの金属イオン封鎖剤のナトリウム塩、カリウム塩およびカルシウム塩、およびそれらの混合物からなる群から選択される特許請求の範囲第16項に記載の方法。

18. カルシウムイオン源が水酸化カルシウム、塩化カルシウム、酢酸カルシウム、ギ酸カルシウム、乳酸カルシウム、硝酸カルシウム、グルコン酸カルシウム、グリセロリン酸カルシウム、安息香酸カルシウム、イソ酪酸カルシウム、プロピオン酸カルシウム、サリチル酸カルシウム、金属イオン封鎖剤のカルシウム塩、およびそれらの混合物からなる群から選択される特許請求の範囲第17項に記載の方法。

19. カルシウムイオン源が水酸化カルシウム、塩

の金属イオン封鎖剤のナトリウム塩、カリウム塩およびカルシウム塩およびそれらの混合物からなる群から選択される特許請求の範囲第14項に記載の方法。

16. カルシウム金属イオン封鎖剤がN-(2-ヒドロキシエチル)-イミノジ酢酸、ニトリロトリ酢酸、N-(2-カルボキシエチル)-イミノジ酢酸、DL-2-メチルニトリロトリ酢酸、N-(ホスホノメチル)-イミノジ酢酸、N-(2-スルホエチル)-イミノジ酢酸、DL-N-(2-ヒドロキシエチル)-2-メチルイミノジ酢酸、N-(2-メトキシエチル)-イミノジ酢酸、N-(2-オキソプロピル)-イミノジ酢酸、N-アセトアミドイミノジ酢酸、N-ヒドロキシエチルエチレンジアミントリ酢酸、2-アミノベンゾイック-N,N'-ジ酢酸、N,N'-ビス-(2-ヒドロキシエチル)-エチレンジニトリロ-N',N'-ジ酢酸、クエン酸、これらの金属イオン封鎖剤のナトリウム塩、カリウム塩およびカルシウム塩、およびそれらの混

合カルシウム、金属イオン封鎖剤のカルシウム塩、およびそれらの混合物からなる群から選択される特許請求の範囲第18項に記載の方法。

20. フッ素イオン源がフッ素イオン約0.02%～約0.10%を与えることができる特許請求の範囲第19項に記載の方法。

21. フッ素イオン源がフッ化ナトリウム、フッ化第一スズ、フッ化カリウム、フッ化亜鉛、フッ化ベタイン、フッ化第一スズアラニン、フルオロケイ酸ナトリウム、フッ化ヘキシルアミン、モノフルオロリン酸ナトリウム、およびそれらの混合物からなる群から選択される特許請求の範囲第20項に記載の方法。

22. 組成物を同時に使用し、一方の組成物はカルシウム金属イオン封鎖剤およびカルシウムイオン少なくとも0.002gを与えることができるカルシウムイオン源を口に与え、そして他方の組成物はフッ素イオン少なくとも0.0001gを与えることができるフッ素イオン源を口に与える特許請求の範囲第21項に記載の方法。

3. 発明の詳細な説明

発明の分野

本発明は、抗むしば保護 (anticaries protection) を歯に与える口腔衛生用製品に関する。本発明の製品は、カルシウムイオン源、フッ素イオン源および CaF_2 の沈殿を制御する特定の結合および溶解特性を有するカルシウム金属イオン封鎖剤からなる。

従来技術

フッ化物がその抗むしば効果を出すと考えられる数種の機構がある。一つの可能な機構は、口腔細菌に対するフッ化物の抗菌効果を包含する。一つの抗菌効果は歯垢の酸性生成の減少に集中するらしい。別の抗菌効果は多糖類合成のフッ化物の抑制に集中し、それによつて歯垢組成の交替を生じさせることができる。

フッ化物が抗むしば保護を与えることができたことと示唆されている第二の機構は、歯エナメル質との相互作用にある。フッ化物およびヒドロキシアパタイト (HA) (エナメル質生成成分) がフルオロ

のはフルオリド源を適用した後、カルシウム源を適用することを包含する。米国特許第4,193,988号明細書は、2つの部分の歯みがき (ゲルおよび練り歯みがきのストライプ) を利用してカルシウムイオン源およびフッ素イオン源を与えている。しかし、前記文献のいずれも制御された CaF_2 沈殿を許す別のカルシウムイオン源およびフッ素イオン源を与えていない。沈殿の防止は米国特許第4,177,258号明細書および米国特許第4,183,915号明細書に示されている。

ジェイ・ディー・ピー・フェザーストーン等のカリエス・リサーチ (Caries Research) 15: 221-235 (1981) は CaF_2 の制御された沈殿を与えることができる組成物を開示しているが、本発明で意図する量ではなく、フルオリド量は本発明の限定以下である。

むしば予防における CaF_2 の可能な役割を開示している文献は、マリオン・ディー・フランシス等の Adv. in Oral Biology 3: 83-120 (1968)、エイツ・ジー・マカンの Arch.

アパタイト (FA) を生成する。フッ化物の増大量が利用できる場合、FA濃度は増大し、最初のエナメル質の溶解度は減少する (FAはHAよりも可溶性ではない) と考えられている。

第三の機構は、処置後に口腔環境内に保持されると歯エナメル質の物質再鉱物化 (remineralization) を促進するフッ化物の能力を包含する。

従来技術は、更にフッ化物を歯エナメル質に与える数種の方法を提案している。例えば、局所高フッ素イオン濃度処置は歯科医によつて施される。これは歯科医への訪問を必要とし、それ故歯への更に容易なフッ化物処置用の方法および製品は求められかつ求められ続けている。

米国特許第2,627,493号明細書は、フッ化物を歯に与えるチューインガムの使用を教示している。米国特許第4,080,440号明細書は、フルオリド源、ホズフエート源およびカルシウム源をエナメル質に与える2つの部分の再鉱物化製品の使用を開示している。別の2部分の製品、例えば米国特許第4,108,980号明細書に開示のも

Oral Biol. 13: 987-1001 (1968)、ザオシヨン・リアングおよびウィリアム・アイ・ヒグチの J. Phys. Chem. 77: 1704-1710 (1973)、ブイ・カラバスカ等の Arch. Oral Biol. 20: 333-339 (1975)、エム・ジョースト・ラルセン等の Scand. Biol. 20: 327-333 (1977)、エス・デュークおよびジー・シー・フオワードの Caries Res. 12: 12-20 (1978)、エム・ジョースト・ラルセンおよびオー・フェジエルスコフの Scand. J. Dent. Res. 86: 337-345 (1978)、オー・フェジエルスコフ等の Acta Odont. Scand. 39: 241-249 (1981)、エス・チャンドラー等の J. Dent. Res. 61: 403-407 (1982) である。

発明の概要

本発明は、制御された過飽和 CaF_2 溶液を歯エナメル質に与えることによつて抗むしば保護を与える。可溶性カルシウムイオン液、特定の溶解度と結合特性とを有するカルシウム金属イオン封鎖剤および可溶性フッ素イオン源を本組成物で使用

する。本発明の一実施法はすべての成分を単一組成物に存在させることを包含する。他の実施法は、カルシウムイオン源およびカルシウム金属イオン封鎖剤を一方の組成物内で使用し、フッ素イオン源を別の組成物内で使用することを包含する。組成物（単数または複数）を使用する場合、フッ化物との水性混合物が CaF_2 の臨界過飽和濃度に近いように遊離カルシウムイオン濃度を緩衝することが望ましい。このことは CaF_2 の最大析出を許すであろう。臨界濃度以下ではすべての成分は単一水性組成物（単安定溶液）に一緒に存在でき、一方臨界濃度以上では2つの別の組成物が好ましい。必須成分並びに場合によつて配合する成分を以下に詳述する。

発明の具体的説明

本発明は、制御量の CaF_2 を歯エナメル質に与えることによつて抗むし保護を与える。本発明は制御されない過度に迅速な CaF_2 沈殿を阻止するのに十分な安定^{度定}数を有するカルシウム金属イオン封鎖剤を使用する。

合に希釈した場合に約4.5～約8.8、好ましくは約6.5～約7.8のpHを有しているべきである。好ましくは、5%よりも多い総イオン性カルシウムおよび可溶性錯化カルシウムを口内に与えるカルシウムイオン源は使用されず、そして最も好ましいカルシウムイオン源はイオンおよび可溶性錯化形態の総可溶性カルシウム約0.04%～約0.25%を与えるべきである。代表的カルシウムイオン源は、例えば水酸化カルシウム、塩化カルシウム、酢酸カルシウム、ギ酸カルシウム、乳酸カルシウム、硝酸カルシウム、グルコン酸カルシウム、グリセロリン酸カルシウム、安息香酸カルシウム、イソ酪酸カルシウム、プロピオン酸カルシウム、サリチル酸カルシウム、およびそれらの混合物である。他の好適なカルシウムイオン源は、例えば前記金属イオン封鎖剤のカルシウム塩である。

好ましいカルシウムイオン源は、例えば金属イオン封鎖剤のカルシウム塩、水酸化カルシウム、塩化カルシウム、およびそれらの混合物である。

カルシウム金属イオン封鎖剤

カルシウムイオン源

本組成物で使用できるカルシウムイオン源は、製品を口内で使用した場合にイオン性形態および金属イオン封鎖剤の可溶性錯体としての総可溶性カルシウム少なくとも約0.015%を与えることができる口腔内で使用するのに安全なカルシウムイオン源である。これはすべての成分が存在する単一の水溶性組成物製品中の濃度でもある。カルシウムイオン源が一方の水溶性組成物内に金属イオン封鎖剤と一緒に存在し、かつフッ素イオン源が別の組成物内に存在する場合には、2つの組成物を混合する際に存在する可溶性カルシウムの量は少なくとも0.015%であるべきである。同様に歯みがきまたは他の非水溶性製品においては可溶性カルシウムの濃度は口内で希釈した場合に（一般に歯みがき1部対唾液および水3部の希釈）少なくとも0.015%である。これらのデータを使用して、当業者は適当な濃度の成分を有する製品を容易に調製できる。組成物（単数または複数）が水溶液である場合、そして水溶液でない場

以下の式によつて定義される好適な安定度定数 K_m を有するカルシウム金属イオン封鎖剤は、 $[\text{Ca}][\text{F}]^2$ のイオン積が $\geq 2 \times 10^{-9} \text{ M}^3$ または立方モル/ ℓ^3 であるような量で組成物を使用した際にカルシウムイオン濃度を緩衝するために使用される。

$$K_m = \frac{[\text{CaA}]}{[\text{Ca}][\text{A}]}$$

（前記式中、 $[\text{CaA}]$ はカルシウムで錯化された金属イオン封鎖剤の総モル濃度であり、 $[\text{A}]$ は金属イオンによつて錯化されていない金属イオン封鎖剤の総モル濃度であり、そして $[\text{Ca}]$ は非錯化カルシウムイオンの総モル濃度を表わす）

イオン積の値 $[\text{Ca}][\text{F}]^2$ は遊離フッ素イオン濃度にも依存することがわかる。それ故、この種の製品に使用するのに適当な金属イオン封鎖剤は、このフッ化物濃度に依存するであろう。 $10^{-2.8} \sim 10^{-5.8} / \text{モル}$ 、好ましくは約 $10^{-3.3} \sim 10^{-5.3} / \text{モル}$ の有効な安定度定数を有する金属イオン封鎖剤は、適量の遊離フッ素イオンを維持しながらカルシウムに対して適当な結合性を与えることが見

い出されている。

この種の金属イオン封鎖剤はイオン形態および錯化形態の総可溶性カルシウムを口内で0.015%以下に減少させないものでもなければならない。これは反応して CaF_2 を生成するのに十分なカルシウムを与えるためである。約0.01~約0.10のモル濃度で存在する金属イオン封鎖剤は、フッ化カルシウム生成用の最適量のカルシウムを与える。

本発明で使用するのに好適な金属イオン封鎖剤の例は、N-(2-ヒドロキシエチル)-イミノ酢酸(アルドリッチ・ケミカル・カンパニーによつて供給される)、ニトリロトリ酢酸(アルドリッチ・ケミカル・カンパニーによつて供給される)、N-(2-カルボキシエチル)-イミノ酢酸、DL-2-メチルニトリロトリ酢酸、N-(ホスホノメチル)-イミノ酢酸、N-(2-スルホエチル)-イミノ酢酸、DL-N-(2-ヒドロキシエチル)-2-メチル-イミノ酢酸、N-(2-メトキシエチル)-イミノ酢酸、N-(2-オキソプロピル)-イミノ酢酸、N-ア

セトアミドイミノ酢酸(アルドリッチ・ケミカル・カンパニーによつて供給される)、N-ヒドロキシエチルエチレンジアミントリ酢酸(アルドリッチ・ケミカル・カンパニーによつて供給される)、2-アミノベンゾイック-N,N'-ジ酢酸、N,N'-ビス-(2-ヒドロキシエチル)-エチレンジニトリロ-N',N'-ジ酢酸、クエン酸およびそれらの混合物(アルドリッチ・ケミカル・カンパニーによつて供給される)、またはそれらの好適な塩、例えばナトリウム塩、カリウム塩およびカルシウム塩[クリタイカル・スタビリティー・コンスタンツ(臨界安定度定数)、エイ・イー・モルテルおよびアール・スミス(プレナム・プレス、ニューヨーク)1974年からとられた]である。好ましい金属イオン封鎖剤は、N-(2-ヒドロキシエチル)-イミノ酢酸、N-ヒドロキシエチルエチレンジアミントリ酢酸、N-アセトアミド酢酸、ニトリロトリ酢酸およびそれらの混合物である。

フッ素イオン源

本発明は、製品を使用した際にフッ素イオン約0.0015%~約0.5%、好ましくは約0.02%~約0.10%を与えるようなフッ素イオン源を包含する。製品組成物(単数または複数)においてカルシウムイオン濃度について前になされた説明をフッ素イオン源にも適用できる。好適なフッ素イオン源は、例えばフッ化ナトリウム、フッ化第一スズ、フッ化カリウム、フッ化亜鉛、フッ化ベタイン、フッ化第一スズアラニン、フルオロケイ酸ナトリウム、フッ化ヘキシルアミン、モノフルオロリン酸ナトリウムおよびそれらの混合物である。好ましいフッ素イオン源はフッ化ナトリウムである。モノフルオロリン酸ナトリウムによつて与えられるフッ素はモノフルオロリン酸塩の加水分解から生じてフッ素イオンおよびリン酸イオンを水溶液中に生じさせる。

最も有効な抗むしば上の利益(フッ化物析出による最小の阻害)を与えるために、リン酸イオン量は本組成物(単数または複数)を使用した場合にオルトリン酸イオンとして0.08%を超えるべき

ではない。

増大した抗むしば保護を与える本組成物を歯に適用する場合、カルシウムイオン少なくとも0.002g、好ましくはカルシウムイオン約0.006~約0.030gがカルシウム金属イオン封鎖剤およびカルシウムイオン源成分によつて与えられるべきであり、一方与えられるフッ素イオン量は少なくとも0.0001gであるべきであり、好ましくは約0.003~約0.015gである。

カルシウムイオン源および金属イオン封鎖剤が一方の組成物に存在しかつフッ素イオン源が別の組成物に存在する2つの別の組成物を利用する供給系の例は以下のもの、即ち洗口料/洗口料、練り歯みがき/練り歯みがき、練り歯みがき/洗口料、洗口料/練り歯みがき、飲料/飲料、キャンディードロップ/キャンディードロップ、粉歯みがき/粉歯みがき等である。前記系は組成物の物理的分離を与えるが、組成物を同時または順次のいずれかに使用でき、好ましくは同時に使用する。即ち2種の洗口料の一部分を使用直前に一緒に混

合するか、2種の練り歯みがきの各々のストリップを単一の歯ブラシにつける等である。

カルシウムイオン物質およびフッ素イオンの物理的分離を与える系の他の例は、限定されないが一方の成分を遅延離脱のためにカプセル化している練り歯みがき、2区画室ビン、積層構造を有するロゼンジ (lozenge)、積層チューインガム等である。

物理的分離を与える前記の系に加えて、分離を与えない単一組成物を使用でき、そして前記した。この種の組成物は単一相洗口料である。

研磨剤 0.5% ~ 50%、好ましくは 5% ~ 35% を使用することによつて好適な練り歯みがきを調製できる。他の成分は、例えば発泡剤約 0.2% ~ 約 7%、粘結剤約 0.1% ~ 約 5%、保湿剤 0% ~ 約 50%、残部水および微量成分である。

練り歯みがきに有用な研磨剤は、例えばシリカキセログル、例えば米国特許第 3,538,230 号明細書に開示のものである。本発明で使用できる他の練り歯みがき研磨剤は、 β 相ピロリン酸カル

シウム、ケイ酸ジルコニウム、および熱硬化性重合樹脂 (米国特許第 3,070,510 号明細書に記載) である。更に、沈降シリカおよび不溶性メタホスフェートを使用できる。研磨剤の混合物は許容でき、シリカキセログルと沈降シリカとの混合物が好ましい。

好適な発泡剤は好ましくは非石けん陰イオン合成洗剤または非イオン合成洗剤である。アルキル基内に炭素数約 10 ~ 約 18 を有するアルキル硫酸の水溶性塩、例えばラウリル硫酸ナトリウムが好適である。本発明で有用な他の種類の発泡剤は炭素数約 10 ~ 約 18 を有する脂肪酸のスルホン化モノグリセリドの水溶性塩であり、モノグリセリドスルホン酸ナトリウムは一例である。タウリンの C_{10} ~ C_{18} 脂肪酸アミドの塩を使用できる。ナトリウム N -メチル- N -パルミトイルタウリドおよび N -コナツツ酸- N -メチルタウリンナトリウムの両方はこのカテゴリーの代表である。イソチオン酸の C_{10} ~ C_{18} 脂肪酸エステル塩、および炭素数 2 ~ 6 を有する飽和モノアミノカルボン酸

および他の食用多価アルコールである。

フレーバーも練り歯みがきに有用である。これらのフレーバーは、例えばフィタグリン油、ペパミント油、スペアミント油、サツサfras油、および多くの他の近似の油である。フレーバー物質と一緒に、甘味剤、例えばサツカリン、デキストロース、レブロース、6-メチルオキササチアジノンおよびナトリウムシクラメートを使用できる。

更に、陽イオン抗菌剤 (例えばビスビグアニドおよび第四級アンモニウム化合物)、例えば米国特許第 4,183,916 号明細書に開示のものも本組成物で使用できる。これらの陽イオン抗菌剤は 2 つの組成物を使用する場合には好ましくはフッ化物組成物に存在するであろう。

本発明を説明するものであつて限定するものではない以下の例は、数種の好適な製品形態を説明する。本明細書においてすべての % および比率は特にことわらない限り重量である。

以下のものは本発明の代表的な 2 つの練り歯みがきである。

の実質上飽和脂肪酸アシルアミドの塩 (アシル基は炭素数 12 ~ 16 を有する) も有用である。ナトリウム- N -ラウリルサルコシドは後者の一例である。

粘結剤も本発明の練り歯みがき組成物で有用である。材料が与える一つの作用は製品を増粘することであり、一方別の作用は練り歯みがき用の所望のコンシステンシーを与えることである。この種の成分は、例えばセルロースエーテルの水溶性塩、例えばカルボキシメチルセルロースナトリウム、ヒドロキシプロピルセルロースナトリウム、およびヒドロキシエチルセルロースナトリウムである。使用できる他の増粘剤は、天然ゴム、例えばカラヤゴム、アラビアゴム、およびトラガカントゴムである。カルボキシビニル重合体 [例えば、ビー・エフ・グッドリッチ・カンパニーの登録商標カルボポールズ (Carbopols)] も有用である。

保湿剤を望ましくは使用して練り歯みがきが硬化しないようにする。好適な保湿剤は、例えばグリセリン、ソルビトール、プロピレングリコール

例 I

カルシウムイオン源練り歯みがき

成 分	重量%
N-(2-ヒドロキシエチル)イミノ酢酸カルシウム	5.23
N-(2-ヒドロキシエチル)イミノ酢酸	0.50
ソルビトール (70% 溶液)	41.17
沈降シリカ	20.00
アルキル硫酸ナトリウム (28.8% 溶液)	4.00
カルボキシメチルセルロース	1.50
キサントガム	0.50
蒸留水	25.00
フレーバー	0.90
二酸化チタン	0.70
サツカリンナトリウム	0.12
水酸化ナトリウム [☆] (50% 溶液)	0.38

☆: pH を 7.75~7.85 に調整

フッ素イオン源練り歯みがき

成 分	重量%
フッ化ナトリウム	0.485
ソルビトール (70% 溶液)	41.00

業者は、洗口料製品に使用できる数種のフレーバーおよび甘味剤を認識しているであろう。

例 II

本発明で使用する 2 つの別の洗口料を以下の成分から調製する。

カルシウムイオン源洗口料

成 分	重量%
水酸化カルシウム	0.28
N-(2-ヒドロキシエチル)-イミノ酢酸	0.88
グリセリン	12.00
エタノール	7.50
フレーバー	0.06
サツカリンナトリウム	0.02
ポリソルベート 80 [☆]	0.06
安息香酸ナトリウム	0.155
蒸留水	79.045

☆ ポリソルベート (Polysorbate) 80: ポリオキシエチレン (20) ソルビタンモノオレエート (ICI アメリカズ・インコーポレーテッド製)

pH を 7.8 に調整

蒸留水	32.945
沈降シリカ	20.00
カルボキシメチルセルロース	1.50
キサントガム	0.50
フレーバー	0.80
アルキル硫酸ナトリウム (28.8% 溶液)	2.00
二酸化チタン	0.70
サツカリンナトリウム	0.02
着色剤	0.05

☆: pH を 7.0 ~ 7.2 に調整

本発明の別の具体例は 2 つの部分の洗口料である。洗口料は典型的にはエチルアルコール約 3% ~ 約 60%、好ましくは 5% ~ 30% を含有する。アルコールは抗菌剤として、そして他の添加剤の可溶化剤として作用する。他の成分は、例えば水約 30% ~ 約 90%、グリセリンのような保湿剤約 5% ~ 約 20%、抗菌剤約 0.01% ~ 約 0.1%、甘味剤約 0.01% ~ 約 0.5%、フレーバー約 0.01%、およびポリオキシエチレン (20) ソルビタンモノオレエートのような乳化剤約 0.1% ~ 約 1% である。当

フッ素イオン源洗口料

成 分	重量%
フッ化ナトリウム	0.10
グリセリン	12.00
エタノール	7.50
フレーバー	0.06
サツカリンナトリウム	0.02
ポリソルベート 80 [☆]	0.06
安息香酸ナトリウム	0.155
蒸留水	80.105

☆ ポリオキシエチレン (20) ソルビタンモノオレエート (ICI アメリカズ・インコーポレーテッド製)

pH を 7.0 に調整

例 III

歯エナメル質により吸収されたフッ化物の有意味な増大が可能である本発明で使用するのに好適な単一洗口料を調製できる。

単一洗口料

成 分	重量%
-----	-----

フッ化ナトリウム	0.05
水酸化カルシウム	0.185
N-ヒドロキシエチルエチレンジアミントリ酢酸	0.720
グリセリン	12.00
エタノール	7.50
フレーバー	0.06
サツカリンナトリウム	0.02
ポリソルベート 80 [☆]	0.06
安息香酸ナトリウム	0.155
蒸留水	79.25

☆：ポリオキシエチレン (20) ソルビタンモノ
オレエート (ICI アメリカズ・インコーポレーテ
ッド製)

pH を 7.5 に調整

前記具体例に加えて、本発明をカルシウム含有
練り歯みがきを使用した後にフッ化物含有洗口料
を使用することによつて実施できる。以下の例は、
本発明で使用するのに好適なこの種の系である。

例 IV

カルシウムイオン源練り歯みがき

サツカリンナトリウム	0.02
ポリソルベート 80 [☆]	0.06
安息香酸ナトリウム	0.155
蒸留水	80.155

☆ ポリオキシエチレン (20) ソルビタンモノ
オレエート (ICI アメリカズ・インコーポレーテ
ッド製)

pH を 7.0 に調整

本発明の別の形態はチューインガムとしてであ
る。当業者は、ガムベース、保湿剤、甘味剤およ
びフレーバーがガムの主成分であることを認識す
るであろう。以下の例は、本発明の必須成分を利
用するチューインガムである。

例 V

カルシウムイオン源

成 分	重量%
Ca(OH) ₂	1.77
N-アセトアミドイミノ酢酸	5.00
ガムベース	25.00
ソルビトル溶液 (70%)	25.00

成 分	重量%
水酸化カルシウム	1.42
N-(2-ヒドロキシエチル)イミノ酢酸	4.23
ソルビトル (70% 溶液)	39.43
沈降シリカ	20.00
アルキル硫酸ナトリウム (28.8% 溶液)	4.00
カルボキシメチルセルロース	1.50
キサンタンガム	0.50
蒸留水	27.20
フレーバー	0.90
二酸化チタン	0.70
サツカリンナトリウム	0.12

☆ pH 7.8 にするための水酸化ナトリウム
(50% 溶液)

フッ素イオン源洗口料

成 分	重量%
フッ化ナトリウム	0.05
グリセリン	12.00
エタノール	7.50
フレーバー	0.06

グリセリン	1.00
マンニトール粉末	40.63
フレーバー	1.50
サツカリンナトリウム	0.10

フッ素イオン源

成 分	重量%
フッ化ナトリウム溶液 (1%)	2.0
ガムベース	25.0
ソルビトル溶液 (70%)	25.0
マンニトール粉末	45.4
グリセリン	1.0
フレーバー	1.5
サツカリンナトリウム	0.1

出願人代理人 猪 股 清